

BENZODIACEPINAS

FARMACOLOGÍA

DR. ISMAEL E. HERRERA T.

BZD. Usuarios.

- Constituyen el paradigma de los tranquilizantes (ansiolíticos).
- Según la APA 1.65% de la población llega a consumirlas por muchos años:
 - Insomnes.
 - Pacientes psiquiátricos con disforia recurrente.
 - Trastornos de ansiedad.
 - Ancianos con enfermedades somáticas.

BZD. Farmacocinética.

- Biodisponibilidad de 70 a 100%.
- El alcohol acelera su absorción.
- IM su absorción es lenta y errática.
- IV en aplicación rápida puede provocar paro respiratorio.
- VO dada la liposolubilidad obtiene niveles terapéuticos estables. Concentraciones máximas en 1-4 horas.

BZD. Farmacocinética.

- 98% de las benzodiacepinas se unen a albúmina lo que prolonga su efecto terapéutico.
- Los alimentos y antiácidos retardan su tiempo de absorción pero no su magnitud, por lo que disminuyen los efectos colaterales.
- La mayoría se metabolizan por la fracción microsomal hepática P-450 y son conjugadas con el ácido glucorónico.
- En hepatopatía la vida media se prolonga hasta 6 veces.

BZD. Farmacodinámica

- El efecto ansiolítico es sobre el sistema límbico y en particular el hipocampo.
- Modifican el receptor GABA y de la glicina.
- Hay receptores específicos para el diazepam en corteza frontal y occipital lo que hace pensar en un ligando endógeno.

BZD. Farmacodinámica

- Se han propuesto dos tipos de receptores benzodiazepínicos:
- I: efecto ansiolítico y antiepiléptico.
- II: efecto sedativo y atáxico.
- Disminuyen el estrés, la agresión y desinhiben.

BZD. Farmacodinámica

● Sobre el EEG:

- Acortan la latencia (el sujeto tarda menos en dormir)
- Disminuyen el estado I e incrementan el II, III y IV.
- Disminuyen el sueño MOR.
- Al suprimir un tratamiento crónico se presenta un rebote MOR.

BZD. MODO DE EMPLEO.

- Iniciar con dosis bajas e incrementar paulatinamente.
- Revalorar periódicamente la dosificación pues la amplitud entre pacientes va de 10 a 22 veces.
- La toma principal debe ser nocturna.
- El efecto terapéutico se nota desde los primeros días a diferencia de AD y NLP.

BZD. MODO DE EMPLEO.

- La sensibilidad aumenta con la edad y hepatopatía.
- Disminuye con el tabaquismo y con la ingesta de alcohol u otros tranquilizantes (tolerancia cruzada).
- Con el tiempo el efecto terapéutico tiende a decrecer, la administración intermitente puede prolongarlo indefinidamente (no siempre).

BZD. MODO DE EMPLEO.

- Se recomienda aplicarlas por periodos breves (promedio 6 semanas).
- En ciertas alteraciones pueden requerir más tiempo o en forma permanente, en especial durante la tercera edad.

BZD. MODO DE EMPLEO.

- El uso intermitente puede proporcionar mayor beneficio permanente, pues permite readaptación de los receptores cerebrales al efecto terapéutico.
- La suspensión debe ser paulatina para evitar estados confusionales y síndrome de abstinencia.

INDICACIONES DE LAS BZD.

- Estados ansiosos psicóticos y no psicóticos con agitación psicomotriz.
- Manifestaciones somáticas de ansiedad y en la ansiedad derivada de una alteración somática.
- Crisis fóbica o de pánico.
- Trastornos musculares con espasmo.

INDICACIONES DE BZD.

- Epilepsia.
- Síndromes de abstinencia por alcohol y otros tranquilizantes.
- Como somnífero en terrores nocturnos y sonambulismo.
- Catatonia esquizofrénica.

INDICACIONES BZD.

- Procesos angustiosos agudos, sociales, psíquicos o biológicos:
 - coadyuvantes en psicoterapia.
 - preoperatorio y postoperatorio.
 - hipertiroidismo.

BZD. EFECTOS COLATERALES.

- Trastornos gastrointestinales: náusea, vómito, diarrea y estreñimiento.
- Alteración motora: torpeza, ataxia.
- Desorientación.
- Fiebre.
- Cefalea.
- Palpitaciones, dolor precordial, hipotensión arterial.

BZD. EFECTOS COLATERALES.

- Leucopenia, granulocitopenia.
- Desorientación, euforia, desinhibición, hostilidad, amnesia.
- Depresión, pesadillas, sialorrea, glaucoma de ángulo estrecho.
- Sequedad de boca, disminución de la profundidad de la respiración.
- Prurito.

BZD. CONTRAINDICACIONES.

- Miastenia gravis.
- Glaucoma de ángulo estrecho.
- Hipersensibilidad a BZD.
- Glaucoma de ángulo estrecho.
- Estados de choque.
- Apnea del sueño.
- Menores de 6 meses y 1er. Trimestre del embarazo.
- Monoterapia en psicosis y depresión mayor.

BZD. INTERACCIONES.

- Depresores del SNC (ADT, NLP, antihistamínicos, fenitoína, barbitúricos) = Amnesia, letargo, estupor y coma.
- Cimetidina= alarga vida media.
- Alcohol= Inhibe biotransformación.
- Anticonceptivos orales = aceleran o inhiben metabolismo.
- Disulfiram= Inhiben la biotransformación.

BZD. PRUEBAS DE LABORATORIO.

- Elevan reversiblemente:

- fosfatasa alcalina.

- TGO

- Bilirrubina directa e indirecta.

- Colesterol sérico.

- Glucosa sanguínea

Normalizan T3 y T4

Cuadros Clínicos

● Trastornos por consumo:

- Dependencia.

- Abuso.

Cuadros Clínicos.

● Trastornos Inducidos:

- Intoxicación.
- Abstinencia, con o sin alteraciones perceptivas.
- Delirium por Intoxicación.
- Demencia persistente.
- Trastorno amnésico persistente.
- T. psicótico con ideas delirantes y/o con alucinaciones.

Cuadros clínicos.

- Trastornos inducidos (continuación).
 - T. del estado de ánimo (iniciado durante la intoxicación o durante la abstinencia).
 - T. de ansiedad (iniciado durante la intoxicación o durante la abstinencia).
 - T. sexual (indicar si inició en la intoxicación)
 - T. del sueño (iniciado durante la intoxicación o durante la abstinencia).

Criterios diagnósticos de intoxicación por Ansiolíticos.

- A. Consumo reciente.
- B. Cambios psicológicos o de conducta desadaptativos y significativos, durante el consumo o poco después:
 - Comportamiento sexual inadecuado.
 - Comportamiento agresivo.
 - Labilidad del ánimo.
 - Deterioro del juicio.
 - Deterioro laboral o social.

Criterios diagnósticos de intoxicación por Ansiolíticos.

- C. Uno o más de los siguientes signos durante o poco después del consumo:
 - Lenguaje farfullante.
 - Incoordinación.
 - Marcha inestable.
 - Nistagmo.
 - Deterioro de la atención o de la memoria.
 - Estupor o coma.
- D. Los síntomas no se explican por la presencia de otra patología médica o mental.

BZD

- Tratamiento de la Intoxicación:
- Inducción del vómito.
- Rehidratación.
- Vigilancia del estado de alerta y función respiratoria.
- Valoración de la aplicación de Flumazenil (Lanexat).
- Intubación endotraqueal,

Criterios diagnósticos de abstinencia por Ansiolíticos.

- A. Interrupción o disminución de un consumo abundante y prolongado.
- B. Dos o más de los siguientes signos que aparecen horas o días después de A
 - Hiperactividad autonómica.
 - Aumento del temblor de manos.
 - Insomnio.
 - Náuseas o vómitos.
 - Alucinaciones o ilusiones transitorias.
 - Agitación psicomotora.
 - Ansiedad.
 - Crisis comiciales tipo gran mal.

Criterios diagnósticos de abstinencia por Ansiolíticos.

- C. Los síntomas del criterio C provocan un malestar significativo o un deterioro social – laboral importantes.
- D. Los síntomas no se explican por la presencia de otra patología médica o mental.